

# 专 利 合 作 条 约

## PCT

专利性国际初步报告

(PCT 第II章)

(PCT 36 和细则 70)

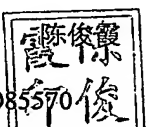
REC'D 05 OCT 2005

WIPO

PCT

申请人或代理人的档案号 IEC040026PCT	关于后续行为 参见 PCT/IPEA/416 表	
国际申请号 PCT/CN2004/000487	国际申请日(日/月/年) 14.5 月 2004 (14.05.2004)	优先权日(日/月/年) 06.6 月 2003 (06.06.2003)
国际专利分类(IPC)或者国家分类和 IPC 两种分类 IPC7 C07D487/04, C07C63/10, C07D207/00, C07D207/34, A61K31/505, A61P15/00 // (C07D487/04, 239:00, 209:00)		
申请人 天津天士力集团有限公司 等		

1. 本报告是国际初步审查单位根据条约 35 做出的国际初步审查报告, 并依照条约 36 将其传送给申请人。 2. 本报告共计 5 页, 包括扉页。 3. <input type="checkbox"/> 本报告还有附件, a. <input type="checkbox"/> (传送给国际局和申请人)共计 _____ 页, 包含 <input type="checkbox"/> 修改后的并且作为本报告基础的说明书修改页、权利要求书修改页和/或附图修改页, 和/或对 本国际初步审查单位所做出的更正页(见 PCT 细则 70.16 和行政规程 607)。 <input type="checkbox"/> 国际初步审查单位认为修改超出原始公开范围的取代页, 参见第 I 栏第 4 项和补充栏。 b. <input type="checkbox"/> (传送给国际局) 共计 (指明电子载体的类型和数量) _____, 包含有在与序列表有关的补充栏中 指明的电子形式的序列表和/或与其相关的表格。(行政规程 802)
4. 本报告包括关于下列各项的内容: I <input checked="" type="checkbox"/> 报告的基础 II <input type="checkbox"/> 优先权 III <input type="checkbox"/> 不做出关于新颖性、创造性和工业实用性的意见 IV <input checked="" type="checkbox"/> 缺乏发明的单一性 V <input checked="" type="checkbox"/> 按条约 35(2)关于新颖性、创造性或工业实用性的理由; 支持这种意见的引证和解释 VI <input type="checkbox"/> 引用的某些文件 VII <input type="checkbox"/> 国际申请中的某些缺陷 VIII <input checked="" type="checkbox"/> 对国际申请的某些意见

提交要求书的日期 30.11 月 2004 (30.11.2004)	完成本报告的日期 02.9 月 2005 (02.09.2005)
中华人民共和国国家知识产权局 IPEA/CN 中国北京市海淀区西土城路 6 号(100088) 传真号: (86-10)62019451	授权官员  电话号码 (86-10)62085570

I. 报告的基础

1. 关于语言, 本报告将基于:

- ☒ 申请提出时使用的语言。
- ☐ 该申请的\_\_\_\_\_语言译文, 提供该种语言的译文是
- ☐ 为了国际检索而提交的译文所使用的语言(细则 12.3 和 23.1 (b))。
- ☐ 为了国际申请的公布而提交的译文所使用的语言(细则 12.4)。
- ☐ 为了国际初步审查而提交的译文所使用的语言(细则55.2和/或55.3)。

2. 关于国际申请中各个部分, 本报告基于(申请人为答复受理局根据条约 14 所发通知而提交的替换页, 在本报告中视为“原始提交”的文件, 不作为本报告的附件)

- ☒ 原始提交的国际申请。
- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 原始提交的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的, \_\_\_\_\_ 初审单位收到的。
- ☐ 序列和/或相关表格——参见与序列有关的补充栏。.

3. 修改导致以下内容的删除:

- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- ☐ 序列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- ☐ 与序列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

4. ☐ 由于本报告附件的(某些)修改, 如下所列, 被认为超出了原始公开的范围, 如补充栏所示, 因此本报告是按照没有修改的情况做出的(细则 70.2(c))。

- ☐ 说明书, 第\_\_\_\_\_页
- ☐ 权利要求, 第\_\_\_\_\_项
- ☐ 附图, 第\_\_\_\_\_页, 图\_\_\_\_\_
- ☐ 序列表(具体说明) \_\_\_\_\_
- ☐ 与序列表相关的表格(具体说明) \_\_\_\_\_

\*如果第 4 项适用, 一些或全部的文件页可能做出“被取代”标记。

IV. 缺乏发明的单一性

1. 在答复限制权利要求或者缴纳附加费的通知书(PCT/IPEA/405 表)时, 申请人在适用期限内:

- ☐ 已经限制了权利要求。
- ☐ 已经缴纳了附加费。
- ☐ 已经缴纳了附加费, 并提出了异议, 缴纳了异议费。
- ☐ 已经缴纳了附加费, 并提出了异议, 但未缴纳异议费。
- ☐ 既没有限制权利要求, 也没有缴纳附加费。

2. ☒ 本国际初步审查单位认为本申请不满足发明单一性的要求, 并且依照细则 68.1 决定不要求申请人限制权利要求或缴纳附加费。

3. 按照细则 13.1、13.2 和 13.3 的规定, 本国际初步审查单位认为发明单一性的要求

- ☐ 已得到满足。
- ☒ 没有得到满足, 理由如下:

本申请涉及化合物、化合物的制备方法、药物组合物和中间体。权利要求 10 中的中间体 IE、IF 与最终产物 I 没有相同的基本结构单元, 并且最终产物 I 也不是由中间体 IE、IF 直接制得的; 虽然中间体 IA、ID 可以直接制得最终产物 I, 但是 IA、ID 与最终产物 I 没有相同的基本结构单元; 因此, 权利要求 10 与 1 不能满足专利合作条约实施细则 13.1、13.2 和 13.3 发明单一性的要求。

4. 因此, 在制定这份报告的过程中, 国际初步审查的主题是国际申请中的下列部分:

- ☒ 全部。
- ☐ 与权利要求 \_\_\_\_\_ 有关的部分。

V. 按条约 35 (2)关于新颖性、创造性或工业实用性的意见：支持这种理由的引证和解释

1. 意见

新颖性(N)	权利要求 1-9	是
	权利要求 10	否
创造性(IS)	权利要求 1-9	是
	权利要求 10	否
工业实用性(IA)	权利要求 1-10	是
	权利要求	否

2. 引证和解释 (细则 70.7)

这里引用下列文献：

D1: CN, A,1422271 (SK 化学株式会社) 04.6 月 2003 (04.06.2003), 权利要求 14, 说明书第 10-11 页, 化合物 (16)、(18) 及实施例;

D2: 中国药物化学杂志, Vol.9, No.3,1999, 申静等人, “昔多芬的新合成方法”, 第220-222页, 化合物 (3)

D3: Journal of Heterocyclic Chemistry, Vol.27, No.7, 1990, Eger, Kurt等人, “Synthesis of pyrrolo[2,3-d]pyrimidine ribosides and their potential in chemotherapeutics”, 第2069-75页, 化合物4b

D4: Liebigs Annalen der Chemie, No.9, 1986, Pichler, Herbert等人, “Synthesis of 7-unsubstituted 7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidines”, 第1485-505页, 化合物1

D5: Synthesis, No.3, 1979, Mattson, Ronald J.等人, “Selective N-1-methylation of 2-aminopyrroles with sodium hydride and dimethyl sulfate”, 第217-18页, 化合物4、5

i. 新颖性

现有技术未公开本申请权利要求 1 的化合物, 因此, 权利要求 1-4 (化合物)、5 (化合物的制备方法)、6-9(药物组合物和用途) 符合 PCT 条约 33 (2) 的规定。

式 IE 和 IF 化合物已分别在 D1-D2 和 D3-D5 中公开, 因此, 本申请的权利要求 10 不符合 PCT 条约 33 (2) 关于新颖性的规定。

ii. 创造性

文献 D1 是最接近的现有技术。本申请权利要求 1 的化合物与 D1 中的化合物结构不同并且 D1 中不存在能使本领域技术人员得到与本申请权利要求 1 的化合物相似结构的暗示。不存在暗示并且由于本申请说明书中描述的所要求保护的化合物的优点, 因此认为权利要求 1-9 具备创造性。

由于具有相似结构和相同用途 (作为制备药物中间体进行同一类反应的原料) 的化合物已经分别在 D1-D5 中公开, 本申请权利要求 10 不具备 PCT 条约 33(3)的规定。

iii. 工业实用性

权利要求 1-10 符合 PCT 条约 33(4)的规定。

VIII. 对国际申请的某些评论意见

就权利要求、说明书和附图的清楚性，或者权利要求是否得到说明书的充分支持提出以下意见：

由于缺少式 I 和基团  $R^1$ - $R^2$  的定义，权利要求 10 不清楚。因此，权利要求 10 不符合 PCT 条约 6 的规定。  
对权利要求 10 的意见以说明书中描述的基团定义为基础。